### (19) 世界知的所有権機関 国際事務局



# 

#### (43) 国際公開日 2005年2月10日(10.02.2005)

**PCT** 

## (10) 国際公開番号 WO 2005/012284 A1

C07D 333/74, 495/04, (51) 国際特許分類7: A61K 31/381, A61P 3/04, 3/06, 3/10

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2004/010944

(22) 国際出願日:

2004年7月30日(30.07.2004)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2003-204357 2003年7月31日(31.07.2003)

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 大正製薬 株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO.LTD.) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田3丁目24番 1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 田口 稔 (TAGUCHI, Minoru) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島 区高田3丁目24番1号大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 鈴木 亮 (SUZUKI, Ryo) [JP/JP]; 〒1708633 東京 都豊島区高田3丁目24番1号 大正製薬株式会社 内 Tokyo (JP). 三上 綾子 (MIKAMI, Ayako) [JP/JP]; 〒 1708633 東京都豊島区高田3丁目24番1号大正製 薬株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 佐鳥 宗一, 外(SATORI, Soichi et al.); 〒 1708633 東京都豊島区高田3丁目24番1号大正 製薬株式会社 知的財産部内 Tokyo (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が 可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可 能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### 添付公開書類:

国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、 定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: 4,5-DIHYDRONAPHTHO[1,2-b]THIOPHENE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 4, 5-ジヒドロナフト [1, 2-b] チオフェン誘導体

(57) Abstract: A 4,5-dihydronaphtho[1,2-b]thiophene derivative represented by the formula (1) (wherein R<sup>1</sup> represents C<sub>1-10</sub> 1-hydroxyalkyl or C<sub>1-10</sub> acyl, and R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> are separately bonded in respective positions selected among the 6-, 7-, 8-, and 9-positions and each independently represents hydrogen, halogeno, C<sub>1-10</sub> alkyl, hydroxy, C<sub>1-10</sub> alkoxy, C<sub>1-5</sub> alkenyloxy, C<sub>1.5</sub> alkynyloxy, benzyloxy, etc., provided that when R<sup>1</sup> is acyl and R<sup>2</sup> is hydrogen, then R<sup>3</sup> is neither hydrogen nor acetyl) or a pharmaceutically acceptable salt of the derivative. It is a

novel compound effective in reducing triglyceride amount in the liver and reducing blood sugar level.

/012284 A1 (57) 要約: 式 (式中、R¹は炭素原子数 1 ~ 1 0 の 1 – ヒドロキシアルキル基又は炭素原子数 1 ~ 1 0 のアシル基を 示し、 $R^2$ 及 $UR^3$ は別々に6位、7位、8位又は9位のいずれかに置換し、 $R^2$ 及 $UR^3$ は独立して、水素原子、 ハロゲン原子、炭素原子数1~10のアルキル基、水酸基、炭素原子数1~10のアルコキシ基、炭素原子数1~ 5のアルケニルオキシ基、炭素原子数 1~5のアルキニルオキシ基、ペンジルオキシ基等を示す。ただし、R¹が アシル基であり、R<sup>2</sup>が水素原子であるときR<sup>3</sup>は水素原子又はアセチル基を除く。)で衷される4, 5-ジヒドロ ナフト[1, 2-b]チオフェン誘導体又はその医薬上許容される塩であり、肝臓中のトリグリセリド低下作用お よび血糖値低下作用を有する新規な化合物である。

